

⑫ 公開特許公報(A)

昭63-14702

⑤Int.Cl.⁴ 識別記号 庁内整理番号 ⑬公開 昭和63年(1988)1月21日
A 01 N 37/02 8519-4H
A 61 K 31/045 ADY 7330-4C
/(A 01 N 37/02
31:02)
(A 61 K 31/045
31:19) 7330-4C 審査請求 未請求 発明の数 2 (全3頁)

⑭発明の名称 広範囲作用をもつ殺ビールス剤

⑮特 願 昭62-127287

⑯出 願 昭62(1987)5月26日

優先権主張 ⑰1986年7月2日⑱西ドイツ(DE)⑲P3622089.2

⑳発 明 者 ユッタ ヘツフラー ドイツ連邦共和国 デー2000ハンブルク20 ボルトゼン
ベック7

㉑発 明 者 ハンスーヨット エツ ドイツ連邦共和国 デー5000 ケルン 1 フェルスト
ガースーブユクラシユト ラーセ 56

㉒出 願 人 クリユーガー ゲーエ ドイツ連邦共和国 デー5060 ベルギツシユ グラツト
ムペーハー ウント バツハ 2 マイゼンベック 2
コ カーゲー

㉓代 理 人 弁理士 砂川 五郎

明 細 書

1. 発明の名称

広範囲作用をもつ殺ビールス剤

2. 特許請求の範囲

(1) 少なくとも70重量%のエタノールおよび/または
プロパノールと0.5ないし5重量%の短鎖の有機酸
とを含有する広範囲作用をもつ殺ビールス剤

(2) 附加的に5重量%までの湿潤剤を含むことを特徴
とする特許請求の範囲1の殺ビールス剤

(3) 有機酸がクエン酸および/またはグリコール酸で
あることを特徴とする特許請求の範囲1または2の殺ビ
ールス剤

(4) 湿潤剤としてコリンドデシルスルホネートを含む
ことを特徴とする特許請求の範囲1ないし3の一つによ
る殺ビールス剤

(5) 附加的に5%までのグリセリンおよび5%までの
ひまし油を含むことを特徴とする特許請求の範囲1ない
し4の一つによる殺ビールス剤

(6) 少なくとも70重量%のエタノールおよび/または
プロパノールおよび0.5ないし5重量%の短鎖有機
酸を含む混合物の広範囲作用を有する殺ビールス剤とし
ての使用法

3. 発明の詳細な説明

本発明の対象は、殊に各種の裸ビールス、即ち、特に問
題視されているビールス種、ポリオビールス1(マホネ
イ株)、ワクチニアビールス(エルストリー株)、SV
40-ビールス(例えば、777株)そしてアデノビールス
2(アデノイド8株)に対し広い作用を有する殺ビール
ス剤である。

リポイド鞘を有するビールスが比較的感受性であり、そ
れ故、公知の殺ビールス性消毒剤で活性をなくすること
が出来ことは知られている。これに対し裸ビールスは
普通の消毒剤に対して本質的に安定であって、従来本来
比較的高濃度のホルムアルデヒドでしか非活性化出来な
かった。ホルムアルデヒドはしかし、毒物学的理由によ
り望ましいものではなく、臨床でも実験室でも汚染した
体の消毒には使用できない。

市販の皮膚に使用できる消毒剤の消毒作用、若くは不活
性化作用に就いての文献は矛盾に満ちている。アルコール
類の有効性に就いての記載もまた矛盾が多い。^(例えは)「イソプ
ロパノールの裸ビールスに対する効力の試験によると、
このアルコールは極めて効力が弱いか、全く無効である。
この試験によると、エタノールやメタノールは30%以
下の水しか含有しない時に有効であることが判った。従
って、本出願人のDE-O S 34 30 709 により、少な

くとも70%のメタノールおよび/またはエタノールと1ないし10%のグリセリンからなる裸ビールスに対する殺ビールス剤は、公知である。

この殺ビールス剤は、さらに5%までのひまし油を含んでよい。グリセリンやひまし油の添加を持ちメタノール及び/又はエタノールを基体とし、裸ビールスに対し広い作用を持つこれら殺ビールス剤の詳細な試験は、しかし、アデノビールス2（アデノイド8株）及び、SV40-ビールス（例えば777株）の様な、問題視されているビールス種の場合、効果が上がらなかった。

DE-OS 32 27 126により、呼吸器ビールスの繁殖がそのビールスを短鎖有機酸と接触させることにより阻止できるか又は妨げられる事が知られている。そこには、クエン酸、リンゴ酸、コハク酸及び安息香酸並びにそれらの置換誘導体が優れた有機酸として挙げられている。更に、その効力は界面活性剤により改善されることが記されている。その際、スルホコハク酸の1、4-ビス（2-エチルヘキシル）-エステルのナトリウム塩やナトリウムドデシルスルファートが優れていることが述べられている。これら薬剤は、普通の呼吸器ビールス、リノビールス、パラインフルエンザビールス及びアデノイドビールスに対して有効である。それらは、それらの酸の場合により湿潤剤と一緒にガーゼやセルロース布に塗布

して使用するのが良い。その他の利用形式は鼻スプレー、顔面クリーム、ハンドローションおよび解のスティックが挙げられる。

そこに述べられた試験結果から分かることは、これらの酸含有の薬剤がアデノイドビールス5に対しても、ある程度の効果を有していることである。しかし10分の2、若しくは98%の減少しか観察されず、しかも、それは一部には、5分の作用時間後そして/または比較的高い濃度で始めて得られた。

ドイツビールス疾患治療連盟及び連邦健康省により、現に新しい規定が作成されているが、それによると、下記4種のビールス株を、その使用目的に就いて容認できる時間内に、例えば、手について2分間以内に不活性化することが出来なければ、“ビールス用薬剤”なる名称を付することが出来ない。上記4種のビールス株はポリオビールス1（マホネイ株）、ワクシニアビールス（エルストレイ株）、SV40-ビールス（例えば777株）及びアデノビールス2（アデノイド8株）である。かくして、広い範囲の作用を示すような殺ビールス剤しか、ビールス剤と名付けてならないと要求されている。

今、驚くべきことに、少なくとも70重量%のエタノールおよび/またはプロパノール及び1ないし5重量%の短鎖有機酸を含有する混合物が、それら条件を充足し、

- 3 -

それ故、広範囲作用をもつ殺ビールス剤とみなすことができることが判った。

それら成果は、短鎖有機酸での自己の試験により、例えば、ポリオビールスに対しては、それらが殆ど無効で、専門家の見解では、大抵の裸のビールスは酸に対して感受性を有しないことが確認されていたので、殊に驚くべきことである。ところが、高パーセントのアルコールと短鎖有機酸との本発明による混合物の場合には、相乗効果が明らかに存在している。ラウリン酸の様な長鎖の有機酸は最早その作用を示すことがない。むしろ、DE-OS 34 30 709により、純アルコールにトリグリセリッドを添加する場合に、似た様な効果が観察される。DE-OS 34 30 707のイソプロパノール単独が有効でないのに、単独又はエタノールと混合したイソプロパノールに酸を添加したものが極めて有効であるとの知見も驚くべきことであった。

かくして、どこにそれらアルコールと短鎖有機酸の有効性があるのかは依然として不明である。両者それぞれでは二、三のビールス株についてのみ有効である。本発明の混合物は、それに反して、問題となっている裸ビールスのすべてを十分且つ完全に不活性化する状態にある。

本発明の対象は、かくして、少なくとも70重量%のエ

- 5 -

- 4 -

タノール及び/又はプロパノール及び、0.5ないし5重量%の短鎖有機酸を含有する殺ビールス剤である。殊に、これら薬剤には、湿潤剤を5重量%まで添加することができる。この新規薬剤を、その効力を減少させることなしに、皮膚清浄化剤にするためには、附加時に5%以下のグリセリン及び5%以下のひまし油を添加してもよい。

本発明の別の対象は、それら混合物の広範囲作用を有する殺ビールス剤としての使用法である。

本発明の薬剤がエタノール、イソプロパノール、n-プロパノール又はそれらの混合物を含有するかどうかは、価格並びにアルコールの営業的使用についての何等かの法規制によって決まることである。即ちエタノールは高価であるし、その上、多くの国で特別規定が設けられていて、本発明の薬剤製造に使用することの障害になる。エタノールの有効性はイソプロパノールの有効性よりも高いので、価格や有効性の理由からして、両アルコールの混合物も使用される。

本発明の薬剤は、かくして有効であって、1ないし2分以内で、問題の裸ビールス株の活動及び感染性を少なくとも4/10程度減少させる。

本発明の薬剤を使用する場合、手消毒剤として使用できる。また、綿、布又は類似の補助剤を用いて、感染した

皮膚の部分に塗布できる。トリグリセリッドは、その不活性化作用の為に、使用に先立って皮脂を先づ除く様にするのが良い。その後で、本発明の薬剤を第2番目に作用させる。グリセリンや場合によりひまし油の含有は、強すぎ且つ望ましくない皮膚の乾燥を妨げ、それ故、自体望ましい注意深いあとの脂付と同様の作用をする。その外、新規製剤の本発明の使用後、皮膚をトリグリセリッドを含有する適当な皮膚防護剤で処理することは全く可能である。何故ならば必要とする消毒、若くは不活性化はトリグリセリッドが存在しなくても進行するからである。

下記実施例及び比較実験から、本発明の殺ウイルス剤の組成と有効性が明らかである。

実施例 1

クエン酸2重量%及び、コリンドデシルスルフォネート2重量%を98重量%の80%エタノールに溶解する。この混合物の一部に1%のひまし油と4%のグリセリンを加える。

実施例 2

2重量%のグリコール酸を18重量%の水と80重量%のエタノールに溶解する。

実施例 3

2重量%のクエン酸を28重量%の水と70重量%のエタノールに溶解する。

実施例 4

2重量%のシクロヘキサンスルフェミン酸を18重量%の水と80重量%のエタノールに溶解する。

実施例 5

2重量%の乳酸を18重量%の水と80重量%のエタノールに溶解する。

実施例 6

2重量%のクエン酸を18重量%の水と80重量%のイソプロパノールに溶解する。

実施例1から6のウイルスを不活性化作用を、10%の牛の胎児の血清の存在下で、ポリオウイルス1型（マホネイ株）に対して検査した。ビールス力価（log 10、PBE/ml）の低下を、1分及び2分の処理時間後測定した。すべての場合ビールス力価は、10分の5以上低下することが判った。イソプロパノールを用いる実施例6だけは、2分後に10分の4.9しか低下しなかった。

比較の為に、80%エタノール、70%エタノール、2%グリコール酸水溶液及び2%クエン酸水溶液を測定した。ビールス力価は、80%エタノールでは約10分の

- 7 -

- 8 -

2、5、70%エタノールでは約10分の1、2、そして、酸水溶液では最大10分の0.5だけ低下した。実施例1ないし6の処方、さらにワクチニアビールス（エルストリー株）、SV 40- ビールス（例えば、77株）及びアデノビールス2（アデノイド8株）に対して試験した。すべての場合において、ビールス力価は、1分ないし2分以内に少なくとも10分の4だけ低下した。エタノール又はプロパノールのみでは、上記のビールスでは十分の作用を全く示さなかった。その他の実験から、短鎖有機酸としては、殊に2ないし6の炭素原子を有するものが問題になることが判った。かくして、水酸基で置換されていることのできる2ないし4個の炭素原子を持つ鎖の長さのモノー、ジー、およびトリカルボン酸が問題になる。その例としては、グリコール酸、くえん酸、乳酸、こはく酸およびりんご酸が挙げられる。同様にシクロヘキサシルスルフェミン酸のようなスルフェミン酸が適当である。

以上

代理人

弁理士(6334) 砂川 五郎
電話 03(402)9088



特許法第17条の2の規定による補正の掲載

昭和62年特許願第127287号(特開昭63-14702号、昭和63年1月21日発行公開特許公報63-148号掲載)については特許法第17条の2の規定による補正があったので下記のとおり掲載する。 3(2)

Int. Cl. 4	識別記号	序内整理番号
A01N 37/02	ADY	8519-4H
A61K 31/045		7330-4C
//(A01N 37/02 31:02)		
(A61K 31/045 31:19)		7330-4C

手続補正書(自発)

昭和63年7月27日

特許庁長官 吉田 文毅殿

1. 事件の表示

昭和62年特許願第127287号

2. 発明の名称

広範囲作用をもつ殺ビールス剤

3. 補正をする者

事件との関係: 特許出願人

居所 ドイツ連邦共和国 ディー5060
ベルギッシュ グラットバッハ 2
マイゼンベック 2

名称 クリューガー ゲーエムベーハー ウント
コ カーゲー

代表者 ウィリィベルト クリューガー
ロルフ ヴァレンディ

国籍 ドイツ連邦共和国

4. 代理人

住所 東京都渋谷区神宮前2-2-39-417
電話(402)9088

氏名 弁理士(6334)砂川 五郎



5. 補正の対象

明細書の発明の詳細な説明の欄

6. 補正の内容

- a) 明細書第4頁下から2行の「及び1ないし」を「及び0.5ないし」と訂正する。
- b) 同6頁15-16行の「障害になる。エタノール」を「障害になるエタノール」に訂正する。
- c) 同8頁12-14行の「実施例1から6の...検査した。」を「実施例1~6の混合物のウイルス不活性化作用を10%の牛の胎児の血清の存在下で、ポリオビールス1型(マホネイ株)について検査した。」と訂正する。
- d) 同9頁2行の「0.5だけ低下した。」を「0.5しか低下しなかった。」に訂正する。